

(12)特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局



(43) 国際公開日
2005年1月6日 (06.01.2005)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2005/000312 A1

(51) 国際特許分類⁷: A61K 31/522, (81) 指定国(表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(21) 国際出願番号: PCT/JP2004/008824

(22) 国際出願日: 2004年6月17日 (17.06.2004)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ: 特願2003-184040 2003年6月27日 (27.06.2003) JP

(71) 出願人(米国を除く全ての指定国について): 大塚製薬株式会社 (OTSUKA PHARMACEUTICAL CO., LTD.) [JP/JP]; 〒1018535 東京都千代田区神田司町2丁目9番地 Tokyo (JP).

(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人(米国についてのみ): 友平 裕三 (TOMOHIRA, Yuson) [JP/JP]; 〒7710182 徳島県徳島市川内町平石寅野224-18 大塚製薬株式会社 製剤研究所内 Tokushima (JP).

(74) 代理人: 三枝 英二, 外 (SAEGUSA, Eiji et al.); 〒5410045 大阪府大阪市中央区道修町1-7-1 北浜TNKビル Osaka (JP).

(84) 指定国(表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:
— 國際調査報告書

2文字コード及び他の略語については、定期発行される各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイドノート」を参照。

(54) Title: SUSTAINED DRUG-RELEASE PARTICLES AND PROCESS FOR PRODUCING THE SAME

(54) 発明の名称: 薬物徐放性粒子及びその製法

WO 2005/000312 A1

(57) **Abstract:** It is intended to provide sustained theophylline-release particles that are sustained theophylline-release particles comprising a polyglycerol fatty acid ester as a matrix base, having a uniform cored particle structure, being able to effectively masking the unpleasant taste of the drug and having excellent properties of controlling the release (elution) of the drug and a high storage stability. More specifically speaking, a process for producing sustained theophylline-release particles characterized by comprising heating a matrix base containing a polyglycerol fatty acid ester, theophylline and ethyl cellulose to give a liquid mixture, spray-cooling the liquid mixture to give spherical cored particles having an average particle size of 250 μ m or less and then melt-coating the cored particles with a fine powder, etc.

(57) **要約:** 本発明は、ポリグリセリン脂肪酸エステルをマトリックス基剤としたテオフィリン徐放性粒子であって、均質な核粒子構造を有し、効果的に薬物の不快な味をマスキングすることができ、優れた薬物の放出(溶出)制御性及び優れた保存安定性を有するテオフィリン徐放性粒子を提供する。具体的には、ポリグリセリン脂肪酸エステルを含むマトリックス基剤、テオフィリン及びエチルセルロースを加熱して液状混合物とし、該液状混合物を噴霧冷却して平均粒子径250 μ m以下の球形の核粒子とし、該核粒子に微粉末を溶融コーティングすることを特徴とするテオフィリン徐放性粒子の製法等を提供する。

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2004/008824

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

Int.Cl⁷ A61K31/522, A61K9/14, A61K47/14, A61K47/22, A61K47/38

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

Int.Cl⁷ A61K31/522, A61K9/14, A61K47/14, A61K47/22, A61K47/38

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)

WPI (DIALOG), BIOSIS (DIALOG), CAS (STN), MEDLINE

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
Y	JP 2002-179571 A (Nikken Chemicals Co., Ltd.), 26 June, 2002 (26.06.02), (Family: none)	1-32
Y	JP 11-171775 A (Nikken Chemicals Co., Ltd.), 29 June, 1999 (29.06.99), & WO 99/16448 A & EP 1025848 A & US 6426091 A	1-32
Y	JP 2002-226304 A (Mitsui Chemicals, Inc.), 14 August, 2002 (14.08.02), (Family: none)	1-32

 Further documents are listed in the continuation of Box C. See patent family annex.

- * Special categories of cited documents:
- "A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
- "E" earlier application or patent but published on or after the international filing date
- "L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
- "O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
- "P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed
- "T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
- "X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
- "Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art
- "&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search
07 September, 2004 (07.09.04)Date of mailing of the international search report
28 September, 2004 (28.09.04)Name and mailing address of the ISA/
Japanese Patent Office

Authorized officer

Facsimile No.

Telephone No.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2004/008824

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	JP 2001-106627 A (Sawai Pharmaceutical Co., Ltd.), 17 April, 2001 (17.04.01), (Family: none)	1-32

国際調査報告

国際出願番号 PCT/JP2004/008824

A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (IPC))

Int. C1' A61K31/522, A61K9/14, A61K47/14, A61K47/22, A61K47/38

B. 調査を行った分野

調査を行った最小限資料 (国際特許分類 (IPC))

Int. C1' A61K31/522, A61K9/14, A61K47/14, A61K47/22, A61K47/38

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

国際調査で使用した電子データベース (データベースの名称、調査に使用した用語)

WPI (DIALOG), BIOSIS (DIALOG), CAS (STN), MEDLINE

C. 関連すると認められる文献

引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
Y	JP 2002-179571 A (日研化学株式会社) 2002. 06. 26 (ファミリーなし)	1-32
Y	JP 11-171775 A (日研化学株式会社) 1999. 06. 29 & WO 99/16448 A & EP 1025848 A & US 6426091 A	1-32
Y	JP 2002-226304 A (三井化学株式会社) 2002. 08. 14 (ファミリーなし)	1-32

 C欄の続きにも文献が列挙されている。 パテントファミリーに関する別紙を参照。

* 引用文献のカテゴリー

「A」特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの

「E」国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの

「L」優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献 (理由を付す)

「O」口頭による開示、使用、展示等に言及する文献

「P」国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願

の日の後に公表された文献

「T」国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの

「X」特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの

「Y」特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの

「&」同一パテントファミリー文献

国際調査を完了した日

07. 09. 2004

国際調査報告の発送日

28. 9. 2004

国際調査機関の名称及びあて先

日本国特許庁 (ISA/JP)

郵便番号100-8915

東京都千代田区霞が関三丁目4番3号

特許庁審査官 (権限のある職員)

加藤 浩

4C 9050

電話番号 03-3581-1101 内線 3452

C (続き) 関連すると認められる文献		関連する 請求の範囲の番号
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	
A	JP 2001-106627 A (沢井製薬株式会社) 2001. 04. 17 (ファミリーなし)	1-32